## (19) 世界知的所有権機関 国際事務局



## 

(43) 国際公開日 2005 年9 月9 日 (09.09.2005)

**PCT** 

## (10) 国際公開番号 WO 2005/082870 A1

(51) 国際特許分類7:

C07D 273/00,

A61K 31/395, A61P 31/10, 35/00, 43/00

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2005/003365

(22) 国際出願日:

2005年3月1日(01.03.2005)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願2004-057442 206

2004年3月2日(02.03.2004) ガ

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): サントリー株式会社 (SUNTORY LIMITED) [JP/JP]; 〒5308203 大阪府大阪市北区堂島浜2丁目1番40号 Osaka (JP).

- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 小田 耕平 (ODA, Kohei) [JP/JP]; 〒5941111 大阪府和泉市光明台2丁 目9-1 O Osaka (JP). 平賀 和三 (HIRAGA, Kazumi) [JP/JP]; 〒6110011 京都府宇治市五ヶ庄官有地京都大 学職員宿舎1-135 Kyoto (JP).
- (74) 代理人: 岩谷 龍 (IWATANI, Ryo); 〒5300003 大阪府 大阪市北区堂島2丁目1番31号 OR I X堂島ビル 3階 Osaka (JP).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI,

NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

## 規則4.17に規定する申立て:

- AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG. ES. FI, GB. GD. GE, GH. GM. HR. HU, ID. IL. IN. IS. JP. KE. KG, KP. KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM. ZW, ARIPO 特許 (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL、SZ、TZ、UG、ZM、ZW)、ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG. KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH. CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特 許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)の指定のための出願し及び特許を与 えられる出願人の資格に関する申立て(規則4.17(ii)) USのみのための発明者である旨の申立て (規則 4.17(iv))
- 添付公開書類:

一 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、 定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: ABC TRANSPORTER INHIBITOR

(54) 発明の名称: ABCトランスポーター阻害剤

(57) Abstract: It is intended to provide an ABC transporter inhibitor whereby the multi-drug resistance against anticancer drugs caused by the amplification and expression of MDR1 gene, which is the most serious problem in chemotherapy for cancer, or the drug resistance of antifungal agents in mycotic diseases can be overcome. Namely, an ABC transporter inhibitor comprising aniacin or its analog as the active ingredient. Because of being capable of inhibiting the transcellular shift/discharge of drugs (in particular, anticancer drugs and antifungal drugs) to the outside cells, this ABC transporter inhibitor is useful in preventing, regulating or inhibiting the acquisition of tolerance against various drugs.

(57) 要約: 本発明は、癌の化学療法での最大の課題であるMDR1遺伝子の増幅・発現による抗癌薬に対する多入 割耐性、あるいは真菌症における抗真菌薬の薬剤耐性を克服するABCトランスポーター阻害剤を提供することを 目的とする。 本発明は、エニアチン類を有効成分として含有するABCトランスポーター阻害剤である。本発明のABCトランスポーター阻害剤は、薬物、特に抗癌薬、抗真菌薬が細胞内から細胞外へ輸送・排泄されるのを阻 害するため、各種薬剤に対する耐性の獲得の予防、抑制又は防止に有用である。



5